

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 1508	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/12158	国際出願日 (日.月.年) 24.09.2003	優先日 (日.月.年) 24.09.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ C07D487/04, A61K31/519, 31/5377, 31/55, 31/553, A61P9/00, 9/10, 21/00, 25/00, 25/14, 25/16, 25/20, 25/24, 25/28, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 協和醗酵工業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。

☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）

☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b ☐ 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎

☐ 第II欄 優先権

☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

☒ 第IV欄 発明の単一性の欠如

☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

☒ 第VI欄 ある種の引用文献

☐ 第VII欄 国際出願の不備

☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 23.04.2004	国際予備審査報告を作成した日 04.11.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 関 政立	4C 8619
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- ☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
- ☐ PCT規則12.4にいう国際公開
- ☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 34-37

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 34-37 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

人の治療方法に係る発明である。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 34-37 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

<input type="checkbox"/>	提出されていない。
<input type="checkbox"/>	所定の基準を満たしていない。
<input type="checkbox"/>	提出されていない。
<input type="checkbox"/>	所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲第1項の一般式(I)で示される化合物は、2-(芳香族)-5-(二級アミン)-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン部分を有する点で共通の構造を有するものであるが、そのような構造に新規性がないことは、後記文献1、2、5、6の記載から明らかである。

したがって、請求の範囲第1項に記載の化合物に係る発明が、かかる化合物がそのような構造部分を有することをもって「特別な技術的特徴」を含む技術的な関係があり、単一の一般的発明概念を形成するように関連しているものとすることはできない。

同項の化合物に係る発明は、その一般式(I)のR³に鑑みると、

- * 1 一般式(I)のR³で「1)」として規定される化合物に係る発明
- * 2 同じく、「2)」及び「8)」として規定される化合物に係る発明
- * 3 同じく、「3)」、「4)」及び「5)」として規定される化合物に係る発明
- * 4 同じく、「6)」及び「7)」として規定される化合物に係る発明
- * 5 同じく、「9)」として規定される化合物に係る発明
- * 6 同じく、「10)」として規定される化合物に係る発明
- * 7 同じく、「11)」として規定される化合物に係る発明

の七発明を構成するものと認める。

そして、請求の範囲第1項を引用する同第2項～第33項についても、上記の*1～*7に対応した七発明を構成する。

4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 請求の範囲1, 2, 22-33のうち一般式(I)のR₃が1)で定義される化合物に係る発明 に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第1.2条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	22-33	有 無
	請求の範囲	1, 2	
進歩性 (IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1, 2, 22-33	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1, 2, 22-33	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1: BROWN, D.J., 他, "Bis-s-triazolo[1,5-a:1',5'-c]pyrimidine and some simple derivatives", Australian Journal of Chemistry, 33(5) pp1147-52 (1980)

文献2: WO 95/03806 A1

文献3: EP 459702 A1

文献4: EP 515107 A1

文献5: WO 98/42711 A1

文献6: WO 00/17201 A1

文献7: JP 2000-502723 A

文献8: JP 2002-513382 A

(1) 文献1には、本願請求の範囲1, 2に記載の化合物に該当する化合物が記載されている。

よって、請求の範囲1, 2に記載の発明は、文献1に記載の発明から新規性及び進歩性を有しない。

(2) 文献2には、式(I)で表される化合物からなるパーキンソン病治療薬が記載されている。

本願請求の範囲1, 2, 22-26, 28, 29, 31に記載の発明と文献2に記載の発明とは、前者は[1, 2, 4]-トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン誘導体に係るものであるのに対し、後者は[1, 2, 4]-トリアゾロ[1, 5-a]-1, 3, 5-トリアジン誘導体に係るものである点において相違する。しかし、医薬品の製造において、1, 3, 5-トリアジン誘導体中の窒素原子を炭素原子に置換してピリミジン誘導体とすることは当業者によく知られた技術的手段であるから(必要ならば、文献7, 8を参照)、文献2に記載の1, 3, 5-トリアジン誘導体中の窒素原子を炭素原子に置換してピリミジン誘導体とすることは当業者が容易に想到する。

よって、本願請求の範囲1, 2, 22-26, 28, 29, 31に記載の発明は、文献2に記載の発明から進歩性を有しない。

3) 文献3, 4には、式(I)で表される化合物がアデノシン拮抗作用を有し、虚血性心疾患や脳疾患等の治療に有効であることが記載されている。

本願請求の範囲1, 2, 22-33に記載の発明と文献3, 4に記載の発明とは、前者は[1, 2, 4]-トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン誘導体に係るものであるのに対し、後者は[1, 2, 4]-トリアゾロ[1, 5-a]-1, 3, 5-トリアジン誘導体に係るものである点において相違する。しかし、この点については、上記(2)と同様である。

よって、本願請求の範囲1, 2, 22-33に記載の発明は、文献3又は4に記

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/68776 A1 [EX]	21. 08. 2003	14. 02. 2003	15. 02. 2002

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

載の発明から進歩性を有しない。

(4) 文献5, 6には、アデノシンA_{2A}受容体拮抗作用を有し、アデノシンA_{2A}受容体の機能亢進に由来する疾患の治療・予防に有用な[1, 2, 4] - トリアゾロ[1, 5-c]ピリミジン誘導体が記載されている。

本願請求の範囲1, 2, 22-33に記載の発明は、一般式(I)における基R³の点において、文献5, 6に記載の発明と異なるものと認められる。しかし、文献5においても上記R³に相当する基として各種の置換基が挙げられており、これは、上記R³に相当する基が様々な置換基を採り得ることを示唆するものである。してみると、文献5, 6に記載の発明において、上記R³基に相当する基を本願請求の範囲に記載の周知の基に変えることは当業者が容易に想到する。

よって、請求の範囲1, 2, 22-33に記載の発明は、文献5又は6に記載の発明から進歩性を有しない。